

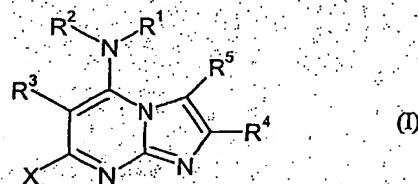
## IMIDAZOLOPYRIMIDINE ALS FUNGIZIDE WIRKSTOFFE

Die Erfindung betrifft Imidazolopyrimidine, ein Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

Es ist bereits bekannt, dass bestimmte Imidazolopyrimidine fungizide Eigenschaften besitzen  
5 (siehe z.B. WO-A 03/022 850).

Da sich aber die ökologischen und ökonomischen Anforderungen an moderne Fungizide laufend erhöhen, beispielsweise was Wirkspektrum, Toxizität, Selektivität, Aufwandmenge, Rückstandsbildung und günstige Herstellbarkeit angeht, und außerdem z.B. Probleme mit Resistenzen auftreten können, besteht die ständige Aufgabe, neue Fungizide zu entwickeln, die zumindest in Teil-  
10 bereichen Vorteile gegenüber den bekannten aufweisen.

Es wurden nun neue Imidazolopyrimidine der Formel (I),



in welcher

15 R<sup>1</sup> für H, R<sup>2</sup>, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkinyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht;

20 R<sup>2</sup> für einen organischen Rest steht, der 3 bis 13 Kohlenstoffatome und ein oder mehrere Siliziumatome enthält, sowie gegebenenfalls 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, und unsubstituiert ist oder substituiert durch 1 bis 4 gleiche oder verschiedene Halogene; oder

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring stehen, der ein oder mehrere Siliziumatome enthält und/oder durch einen oder mehrere Reste R<sup>2</sup> substituiert ist;

25 R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Aryl, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkinyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes

Aralkyl, Halogen, eine gegebenenfalls substituierte Aminogruppe, gegebenenfalls substituiertes ( $C_1$ - $C_8$ )-Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes ( $C_1$ - $C_8$ )-Alkylthio, gegebenenfalls substituiertes ( $C_6$ - $C_{10}$ )-Aryloxy, gegebenenfalls substituiertes ( $C_6$ - $C_{10}$ )-Arylthio, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyloxy, gegebenenfalls substituiertes ( $C_6$ - $C_{10}$ )-Aryl- $(C_1$ - $C_4)$ -alkoxy, gegebenenfalls substituiertes ( $C_6$ - $C_{10}$ )-Aryl- $(C_1$ - $C_4)$ -alkylthio, gegebenenfalls substituiertes Heterocycl- $(C_1$ - $C_4)$ -alkoxy oder gegebenenfalls substituiertes Heterocycl- $(C_1$ - $C_4)$ -alkylthio steht;

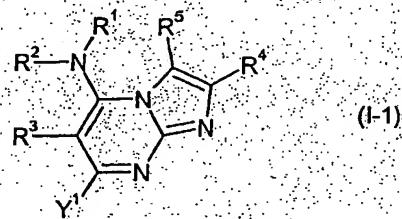
5                    R<sup>4</sup>        für H, Halogen, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl steht;

10                R<sup>5</sup>        für H, Halogen, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl steht; und

                  X        für Halogen, Cyano, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht;

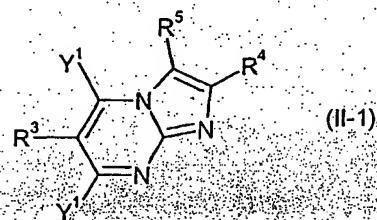
sowie deren Salze, gefunden.

15                Weiterhin wurde gefunden, dass sich Imidazolopyrimidine der Formel (I-1),



die sich von den Verbindungen (I) dadurch ableiten, dass X für Y<sup>1</sup> = Halogen steht, herstellen lassen, indem man:

Verfahren (a) Halogenimidazolopyrimidine der Formel (II-1),



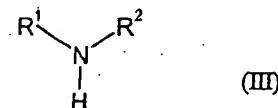
20

in welcher

$R^3, R^4, R^5$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und

$Y^1$  für Halogen steht,

mit Aminen der Formel (III),

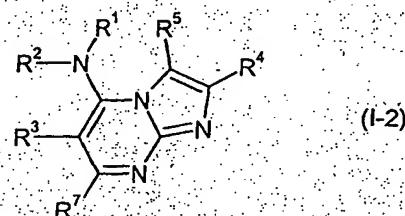


5 in welcher

$R^1$  und  $R^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators umsetzt.

Weiterhin wurde gefunden, dass sich Imidazolopyrimidine der Formel (I-2),

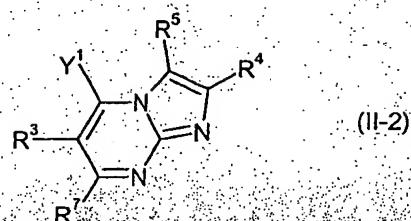


10

die sich von den Verbindungen (I) dadurch ableiten, dass X für  $R^7$  steht, wobei  $R^7$  gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl bedeutet, herstellen lassen, indem man:

Verfahren (b)

15 Halogenimidazolopyrimidine der Formel (II-2),



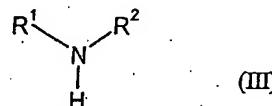
in welcher

$R^3, R^4, R^5$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und

$Y^1$  für Halogen und

$R^7$  für gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht;

mit Aminen der Formel (III),



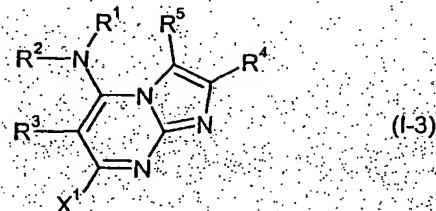
5

in welcher

$R^1$  und  $R^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators umsetzt.

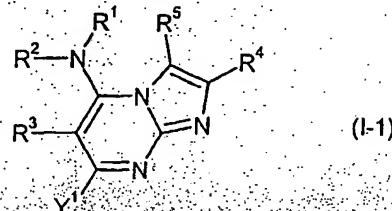
10 Weiterhin wurde gefunden, dass sich Imidazolopyrimidine der Formel (I-3),



die sich von den Verbindungen (I) dadurch ableiten, dass  $X$  für  $X^1$  = Cyano oder gegebenenfalls substituiertes Alkoxy steht, herstellen lassen, indem man:

Verfahren (c)

15 die bereits genannten Imidazolopyrimidine der Formel (I-1)



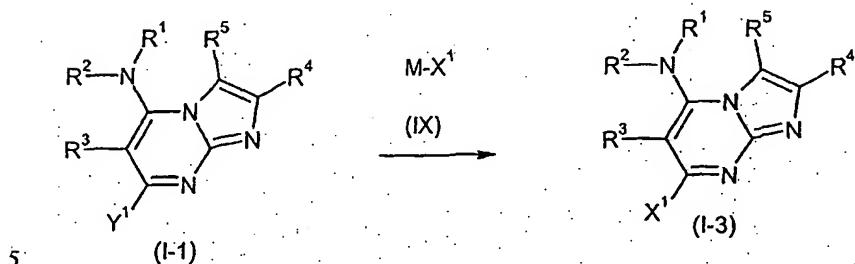
in Analogie zu WO-A 02/083677 mit einer

Verbindung der Formel M-X1 (IX),

in der das Kation M z.B. Ammonium, Tetraalkylammonium, ein Alkalimetall, wie Lithium, Natrium oder Kalium, oder ein Erdalkalimetall, wie Magnesium, bedeutet und in der

X<sup>1</sup> Cyano, Alkoxy oder substituiertes Alkoxy, wie Halogenalkoxy, bedeutet,

umsetzt:



Schließlich wurde gefunden, dass sich die Imidazolopyrimidine der Formel (I) sehr gut zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen eignen. Sie zeigen vor allem eine starke fungizide Wirksamkeit und lassen sich sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwenden.

10 Die erfundungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) können gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, wie R- und S-Isomeren oder Atropisomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen.

Die erfahrungsgemäßen Imidazolopyrimidine sind durch die Formel (I) allgemein definiert.

Bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), in denen

15. a<sup>1)</sup> R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Aryl, oder

a<sup>2)</sup> R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Heterocycl, oder

a<sup>3)</sup> R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, oder

a<sup>4)</sup> R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, oder

a<sup>5)</sup> R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkinyl, oder

20 a<sup>6)</sup> R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, oder

a<sup>7)</sup> R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Aralkyl, oder

a<sup>8)</sup> R<sup>3</sup> für eine gegebenenfalls substituierte Aminogruppe steht.

Ebenso bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), in denen R<sup>3</sup> eine der folgenden Bedeutungen hat:

- b<sup>1</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>,
- b<sup>2</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>8</sup>,
- 5 b<sup>3</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,
- b<sup>4</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,
- b<sup>5</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,
- b<sup>6</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,
- b<sup>7</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,
- 10 b<sup>8</sup>: a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>.

Weiterhin bevorzugt sind diejenigen Stoffe der Formel (I), in denen ein oder mehrere Symbole eine der im folgenden angegebenen bevorzugten Bedeutungen haben, d.h., in denen

- R<sup>1</sup> für H steht; oder
- R<sup>1</sup> für einen Rest R<sup>2</sup> steht, oder
- 15 R<sup>1</sup> für Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis fünffach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, oder
- R<sup>1</sup> für Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, oder
- 20 R<sup>1</sup> für Alkinyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, oder
- R<sup>1</sup> für Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen und/oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, oder
- 25

R<sup>1</sup> für gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl mit 3 bis 8 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroatomen, wie Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel, steht, wobei das Heterocycl einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cyano und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen,

5 R<sup>2</sup> für eine aliphatische, gesättigte oder ungesättigte Gruppe mit 1 bis 13 Kohlenstoffatomen und einem oder mehreren Siliziumatomen steht, die gegebenenfalls 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthält und die unsubstituiert oder durch 1 bis 4 gleiche oder verschiedene Halogenatome substituiert ist, oder

10 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten heterocyclischen Ring mit 3 bis 8 Ringgliedern stehen, der ein oder mehrere Siliziumatome enthält und/oder durch einen oder mehrere Reste R<sup>2</sup> substituiert ist, wobei der Heterocyclus ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglied enthalten kann und wobei der Heterocyclus weiterhin bis zu dreifach substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Fluor- und/oder Chloratomen,

15 R<sup>3</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl oder Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alkyl steht, wobei R<sup>3</sup> unsubstituiert oder teilweise oder vollständig halogeniert ist und/oder gegebenenfalls ein bis drei Reste aus der Gruppe RX tragt, oder C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Halogenalkyl, das gegebenenfalls ein bis drei Reste aus der Gruppe RX tragt, und RX Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Haloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy und gegebenenfalls halogeniertes Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkenoxy, Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyloxy bedeutet,

20 R<sup>3</sup> für Phenyl, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

25 jeweils geradketiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

30

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

5                   jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

10                  jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 11 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

15                  jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy carbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

20                  Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen;

15                  in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, 1,4-Butandiyl, Methylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-O-) oder 1,2-Ethylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

oder

25                  R<sup>3</sup>            für gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl mit 3 bis 8 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, wobei das Heterocycl einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Haloalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Haloalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cyano, Nitro und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen;

oder

30                  R<sup>3</sup>            für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, Di-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkenylamino, Di-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkinylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-alkinylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Arylamino, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, Heterocycl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino oder Heterocycl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino;

R<sup>4</sup> für H, Halogen, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes Cyclopropyl;

R<sup>5</sup> für H, Halogen, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes Cyclopropyl; und

X für H, Fluor, Chlor, Brom oder CN steht.

Besonders bevorzugt sind diejenigen Imidazolopyrimidine der Formel (I), in denen ein oder mehrere der Symbole eine der im folgenden aufgeführten besonders bevorzugten Bedeutungen haben, d.h., in denen

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl;

R<sup>2</sup> für eine Gruppe Y<sup>2</sup>-Si(O<sub>m</sub>CH<sub>3</sub>)(O<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>)(O<sub>p</sub>Y<sup>3</sup>),

wobei m, n und p unabhängig voneinander 0 oder 1;

Y<sup>2</sup> eine Bindung oder Alkandiyl, Alkendiyl oder Alkirdiyl, die jeweils geradkettig oder verzweigt sind, 1 bis 6, bzw. 2 bis 6 Kohlenstoffatome aufweisen, gegebenenfalls durch ein oder zwei nicht benachbarte Sauerstoffatome unterbrochen und unsubstituiert oder durch ein bis drei gleiche oder verschiedene Halogenatome substituiert sind; und

Y<sup>3</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit 1 bis 5 bzw. 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, gegebenenfalls durch ein Sauerstoff-Stickstoff- oder Schwefelatom unterbrochen und unsubstituiert oder durch 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Halogenatome substituiert, bedeuten;

R<sup>3</sup> für (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, Benzyl oder

R<sup>3</sup> für Phenyl, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluoromethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchloromethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchloromethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethoxy, Trifluor-

ethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

5

für in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, 1,4-Butandiyl, Methylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-O-) oder 1,2-Ethylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl,

10 R<sup>3</sup> für Pyridyl, das in 2- oder 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder

15 R<sup>3</sup> für Pyrimidyl, das in 2- oder 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder

20 R<sup>3</sup> für Thiényl, das in 2- oder 3-Stellung verknüpft ist und einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder

25 R<sup>3</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino oder Di-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, oder

30 R<sup>3</sup> für Thiazolyl, das in 2-, 4- oder 5-Stellung verknüpft ist und einfach bis zweifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder

35 R<sup>3</sup> für N-Piperidinyl, N-Tetrazolyl, N-Pyrazolyl, N-Imidazolyl, N-1,2,4-Triazolyl, N-Pyrrolyl, oder N-Morpholinyl, die jeweils unsubstituiert oder ein- oder - falls möglich - mehrfach gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl substituiert sind.

R<sup>4</sup> für H, Cl, F, CH<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder Cyclopropyl;

R<sup>5</sup> für H, Cl, F, CH<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder Cyclopropyl; und

X für H, F, Cl, CN, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Fluor- oder Chloratome substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl

5 steht.

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), worin ein oder mehrere der Symbole eine der im folgenden aufgeführten ganz besonders bevorzugten Bedeutungen haben, d.h., in denen

R<sup>1</sup> für H;

R<sup>2</sup> für SiMe<sub>3</sub>, SiMe<sub>2</sub>Et, SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>,

10 SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,

CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,

CHMeSiMe<sub>3</sub>, CHMeSiMe<sub>2</sub>OMe, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,

(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Me,

(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,

15 CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Me, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,

CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CFMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe,

CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CHMeSiMe<sub>3</sub>,

CH<sub>2</sub>CHMeSiMe<sub>2</sub>Et, CH<sub>2</sub>CHMeSiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CHMeCHMeSiMe<sub>3</sub>, CMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>3</sub>,

20 (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>,

(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et,

CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,

CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, CMe=CHSiMe<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, -C≡C-SiMe<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-C≡C-

SiMe<sub>3</sub> oder -CHMe-C≡C-SiMe<sub>3</sub>;

25 R<sup>3</sup> für (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, wobei R<sup>3</sup> unsubstituiert oder durch ein oder mehrere Fluor- oder Chloratome substituiert ist,

oder

R<sup>3</sup> für 2,4- oder 2,6-disubstituiertes Phenyl; oder für 2-substituiertes Phenyl oder für 2,4,6-trisubstituiertes Phenyl.

5     $R^3$     für Pyridyl, das in 2- oder 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder

10    $R^3$     für Pyrimidyl, das in 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl;

15    $R^4$     für H, -CH<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, Cl oder Cyclopropyl;

20    $R^5$     für H, -CH<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, Cl oder Cyclopropyl; und

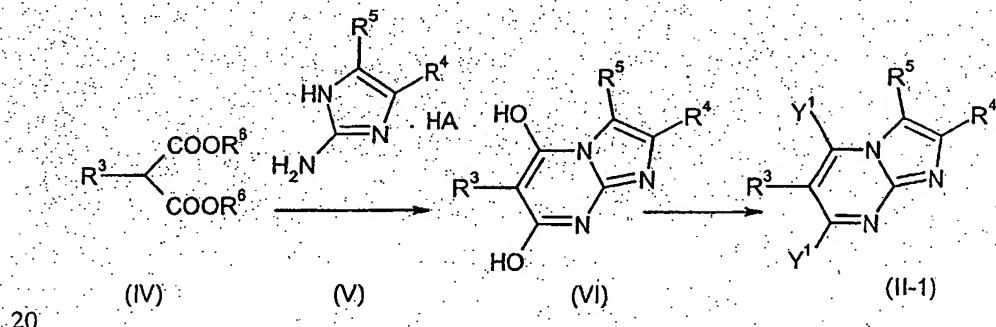
X    für Fluor, Chlor, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Haloalkyl steht.

Die zuvor genannten Reste-Definitionen können untereinander in beliebiger Weise kombiniert werden. Außerdem können einzelne Definitionen entfallen.

Die als Ausgangsstoffe eingesetzten Halogenimidazolopyrimidine der Formel (II-1) und der 15 Formel (II-2) lassen sich analog zu den in der WO-A 03/022850 angegebenen Herstellungsverfahren durch Verfahren (d) und Verfahren (e) synthetisieren:

Verfahren (d):

Dieses bekannte Verfahren dient zur Herstellung von Ausgangsstoffen (II-1), die nach dem oben stehenden Verfahren (a) zu den Imidazolopyrimidinen der Formel (I-1) umgesetzt werden können,

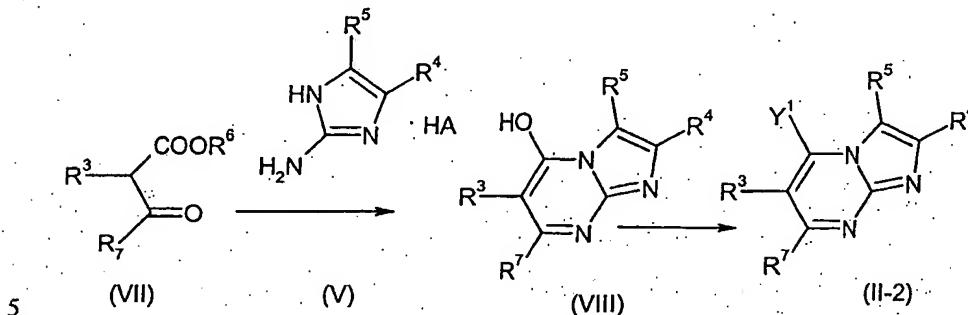


20

wobei die Symbole die oben angegebenen Bedeutungen haben

### Verfahren (e):

Dieses bekannte Verfahren dient zur Herstellung der Halogenimidazolopyrimidine der Formel (II-2), die nach dem oben stehenden Verfahren (b) zu den Imidazolopyrimidinen der Formel (I-2) umgesetzt werden können,

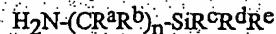


wobei die Symbole die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Die weiterhin zur Durchführung der erfundungsgemäßen Verfahren als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel haben  $R^1$  und  $R^2$  vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfundungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für  $R^1$  und  $R^2$  als bevorzugt angegeben wurden.

Die Amine der Formel (III) sind bekannt. Sie sind teilweise käuflich erhältlich oder lassen sich nach bekannten, dem Fachmann geläufigen Methoden herstellen.

So sind silylierte Amine der Formel (IIIa),

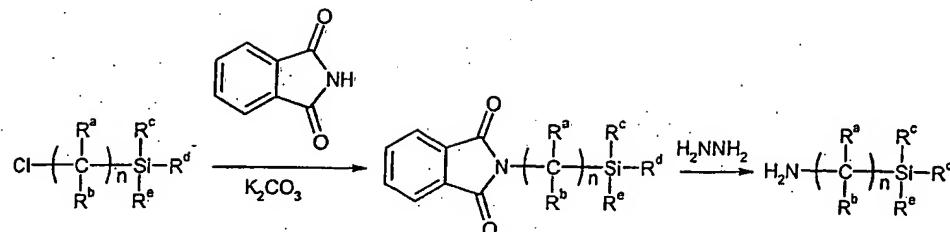


15. **worin**

n eine natürliche Zahl von 0 bis 10 und

$R^a, R^b, R^c, R^d$  gleich oder verschieden H,  $CH_3$  oder  $C_2H_5$  bedeuten (wobei die Gesamtzahl der C-Atome in  $R^a-d \leq 12$  ist),

allgemein zugänglich, indem man beispielsweise Phthalimid in Gegenwart einer Base, wie  $K_2CO_3$ , mit einem Halogenalkylsilan umsetzt und das entstandene N-substituierte Phthalimid mit Hydrazin spaltet.



Solche Synthesen sind beispielsweise beschrieben in J. Am. Chem. Soc. 1951, 73, 5130 oder J. Organomet. Chem. 1978, 174, C18.

Haloalkylsilane sind käuflich oder können nach bekannten, dem Fachmann geläufigen Methoden 5 hergestellt werden (siehe z.B. Houben-Weyl, Band 13/5, S. 65 ff. oder Science of Synthesis, Vol. 4, S. 247 ff.).

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) werden im Allgemeinen unter Atmosphärendruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder verminderndem Druck zu arbeiten:

10 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) alle üblichen inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester, wie Essigsäuremethyl-ester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) 20 alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen oder organischen Basen in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Lithium-diisopropylamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, 25 Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat und Natriumhydrogencarbonat, und außerdem Ammonium-Verbindungen wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat und Ammoniumcarbonat sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylaminolin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylamino-

pyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahren (c) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen oder organischen Basen in Frage. Vorzugsweise 5 verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallacetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat und Natriumhydrogencarbonat, und außerdem Ammonium-Verbindungen, wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat und Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 10 N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Als Katalysatoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) und (c) alle für derartige Umsetzungen üblichen Reaktionsbeschleuniger in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Fluoride, wie Natriumfluorid, Kaliumfluorid oder Ammoniumfluorid.

15 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (b) und (c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0°C und 80°C.

Bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (b) setzt man auf 1 mol an 20 Dihalogen-triazolo-pyrimidin der Formel (II-1) bzw. (II-2) im Allgemeinen 0,5 bis 10 mol, vorzugsweise 0,8 bis 2 mol an Amin der Formel (III) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) setzt man auf 1 mol an Dihalogen-triazolo-pyrimidin der Formel (II-1) bzw. (II-2) im Allgemeinen 0,5 bis 10 mol, vorzugsweise 0,8 bis 2 mol an M-X<sup>1</sup> der Formel (IX) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

25 Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

Fungizide lassen sich im Pflanzenschutz beispielsweise zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und

30 Deuteromycetes einsetzen.

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz beispielsweise zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

- 5 Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;
- Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
- Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;
- Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;
- Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;
- 10 Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder *Pseudoperonospora cubensis*;
- Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;
- Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;
- Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisii* oder *P. brassicae*;
- 15 Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;
- Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;
- Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;
- Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;
- Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*
- 20 (Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
- Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus* (Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
- Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;
- Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;
- 25 Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;
- Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;
- Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;
- Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;
- Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;
- 30 Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;
- Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;
- Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;
- Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;
- Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;
- 35 Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;

Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercospora herpotrichoides*.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine sehr gute stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

5 Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

10 15 Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen *Erysiphe*-Arten, von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen *Botrytis*-, *Venturia*-, *Sphaerotheca*- und *Podosphaera*-Arten, einsetzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

20 25 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsme-

thoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, 5 Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt 10 direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

15 Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können 20 technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlenschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und 25 Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlenschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmel- 30 pilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,  
Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,  
Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,  
Coniophora, wie *Coniophora puetana*,  
5 Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,  
Penicillium, wie *Penicillium glaucum*,  
Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,  
Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,  
Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,  
10 Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,  
Escherichia, wie *Escherichia coli*,  
Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,  
Staphylococcus, wie *Staphylococcus aureus*.

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/ oder chemischen  
15 Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder Schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im Wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylen oder Methylchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfractionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol, sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlenstoffdioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talcum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie

Calcit, Bims, Marmor, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnusschalen, Maiskolben und Tabakstägel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen infrage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether; z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfatblaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel, wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe, wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau, und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe, und Spurenährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink, verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfundungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen infrage:

**Fungizide:**

25. 2-Phenylphenol; 8-Hydroxyquinoline sulfate; Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin; Benalaxyl; Benalaxyl-M; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Boscalid; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamine; Calcium polysulfide; Capsirynycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; 30. Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobentiazone; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolinate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofuanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Dicloromezine;

Dicloran; Diethofencarb; Difenconazole; Dislumetorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon; Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; 5 Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxy; Furametpyr; Furcarbanil; Furmecyclox; Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; 10 Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesilate); Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaliedione; Kasugamycin; Kresoxim-methyl; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomycin; Myclobutanil; 15 Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl; Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Oryastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin; Paclobutrazol; Pefurazone; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propanosine-sodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothiconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrisetox; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxysten; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiaabendazole; Thicyofen; 20 Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Toleclofos-methyl; Tolyfluamid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforme; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide; 25 (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorphenyl)-2-propyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamid; 1-(1-Naphthalinyl)-1H-pyrrol-2,5-dion; 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin; 2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolcarboxamid; 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid; 3,4,5-Trichlor-2,6-pyridindicarbonitril; Actinovate; cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol; Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat; Monokaliumcarbonat; N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid; N-Butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amin; Natriumtetracarbonat;

30 sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux Mischung; Kupferhydroxid; Kupfernaphthenat; Kupferoxychlorid; Kupfersulfat; Cufraneb; Kupferoxid; Mancooper; Kupferoxin.

Bakterizide:

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-Dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

**Insektizide / Akarizide / Nematizide:**

5 *1. Acetylcholinesterase (AChE) Inhibitoren*

1.1 Carbamate (z.B. Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allyxycarb, Aminocarb, Azamethiphos, Bendiocarb, Benfuracarb, Bifencarb, Butacarb, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Carbaryl, Carbifuran, Carbosulfan, Chloethocarb, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Dimetilan, Ethiofen carb, Fenobucarb, Fenothiocarb, Formetanate, Furathiocarb, Isopropcarb, Metam-sodium, 10 Methiocarb, Methomyl, Metolcarb, Oxamyl, Pirimicarb, Promecarb, Propoxur, Thiodicarb, Thiofanox, Triazamate, Trimethacarb, XMC, Xylcarb)

1.2 Organophosphate (z.B. Acephate, Azamethiphos, Azinphos (-methyl, -ethyl), Brómophos-ethyl, Bromfenvinfos (-methyl), Butathiofos, Cadusafos, Carbophenothion, Chlórethoxyfos, Chlorfenvinphos, Chlormephos, Chlorpyrifos (-methyl/-ethyl), Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, 15 Chlorfenvinphos, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methylsulphon, Dialifos, Diazinon, Dichlofen-thion, Dichlorvos/DDVP, Dicrotophos, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dioxabenzofos, Disulfoton, EPN, Ethion, Ethoprophos, Etrinphos, Famphur, Fenamiphos, Fenitrothion, Fensulfothion, Fenthion, Flupyrazofos, Fonofos, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Heptenophos, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isopropyl O-salicylate, Isoxathion, Malathion, 20 Mecarbam, Methacrifos, Methamidophos, Methidathion, Mevinphos, Monocrotophos, Naled, Ométhoate, Oxydemeton-methyl, Parathion (-methyl/-ethyl), Phenhoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phoshamidon, Phosphocarb, Phoxim, Pirimiphos (-methyl/-ethyl), Profenofos, Propaphos, Propetamphos, Prothiofos, Prothoate, Pyraclofos, Pyridaphenthion, Pyridathion, Quinalphos, Sebufos, Sulfotep, Sulprofos, Tebupirimfos, Temephos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, 25 Thiometon, Triazophos, Triclorfon, Vamidothion)

2. *Natrium-Kanal-Modulatoren / Spannungsabhängige Natrium-Kanal-Blocker*

2.1 Pyrethroide (z.B. Acrinathrin, Allethrin (d-cis-trans, d-trans), Beta-Cyfluthrin, Bifenthrin, Bio-allethrin, Bioallethrin-S-cyclopentyl-isomer, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Chlovaporthrin, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clocythrin, Cycloprothrin, 30 Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cypermethrin (alpha-, beta-, theta-, zeta-), Cyphenothrin, DDT, Deltamethrin, Empenthrin (1R-isomer), Esfenvalerate, Etofenprox, Fenfluthrin, Fenpropathrin, Fenpyrithrin, Fenvalerate, Flubrocyclinate, Flucythrinate, Flufenprox, Flumethrin, Fluvalinate,

Fubfenprox, Gamma-Cyhalothrin, Imiprothrin, Kadethrin, Lambda-Cyhalothrin, Metofluthrin, Permethrin (cis-, trans-), Phenothrin (1R-trans isomer), Prallethrin, Profluthrin, Protrifenbute, Pyresmethrin, Resmethrin, RU 15525, Silafluofen, Tau-Fluvalinate, Tefluthrin, Terallethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tralomethrin, Transfluthrin, ZXI 8901, Pyrethrins (pyrethrum))

5 2.2 Oxadiazine (z.B. Indoxacarb)

3. *Acetylcholin-Rezeptor-Agonisten/-Antagonisten*

3.1 Chloronicotinyle/Neonicotinoide (z.B. Acetamiprid, Clothianidin, Dinotefuran, Imidacloprid, Nitenpyram, Nithiazine, Thiacloprid, Thiamethoxam)

3.2 Nicotine, Bensulfat, Cartap

10 4. *Acetylcholin-Rezeptor-Modulatoren*

4.1 Spinosyne (z.B. Spinosad)

5. *GABA-gesteuerte Chlorid-Kanal-Antagonisten*

5.1 Cyclodiene Organochlorine (z.B. Camphechlor, Chlordane, Endosulfan, Gamma-HCH, HCH, Heptachlor, Lindane, Methoxychlor)

15 5.2 Fiprole (z.B. Acetoprole, Ethiprole, Fipronil, Vaniliprole).

6. *Chlorid-Kanal-Aktivatoren*

6.1 Mectine (z.B. Abamectin, Avermectin, Emamectin, Emamectin-benzoate, Ivermectin, Milbemectin, Milbemycin)

7. *Juvenilhormon-Mimetika*

20 (z.B. Diofenolan, Epofenonane, Fenoxy carb, Hydroprene, Kinoprene, Methoprene, Pyriproxyfen, Triprene)

8. *Ecdysonagonisten/disruptoren*

8.1 Diacylhydrazine (z.B. Chromafenozone, Halofenozone, Methoxyfenozone, Tebufenozone)

9. *Inhibitoren der Chitinbiosynthese*

9.1 Benzoylharnstoffe (z.B. Bistrifluron, Chlofluazuron, Disflubenzuron, Fluazuron, Flucyclouron, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Lufenuron, Novaluron, Noviflumuron, Penfluron, Teflubenzuron, Triflumuron)

9.2 Buprofezin

5 9.3 Cyromazine

*10. Inhibitoren der oxidativen Phosphorylierung, ATP-Disruptoren*

10.1 Diafenthiuron

10.2 Organotine (z.B. Azocyclotin, Cyhexatin, Fenbutatin-oxide)

*11. Entkoppler der oxidativen Phosphorylierung durch Unterbrechung des H-Protongradienten*

10 11.1 Pyrrole (z.B. Chlorfenapyr)

11.2 Dinitrophenole (z.B. Binapacyrl, Dinobution, Dinocap, DNOC)

*12. Site-I-Elektronentransportinhibitoren*

12.1 METIs (z.B. Fenazaquin, Fenpyroximate, Pyrimidifen, Pyridaben, Tebufenpyrad, Tolfenpyrad)

15 12.2 Hydramethylnone

12.3 Dicofol

*13. Site-II-Elektronentransportinhibitoren*

13.1 Rotenone

*14. Site-III-Elektronentransportinhibitoren*

20 14.1 Acequinocyl, Fluacrypyrim

*15. Mikrobielle Disruptoren der Insektdarmmembran*

*Bacillus thuringiensis*-Stämme

*16. Inhibitoren der Fettsynthese*

16.1 Tetrosäuren (z.B. Spirodiclofen, Spiromesifen)

16.2 Tetraäsuren [z.B. 3-(2,5-Dimethylphenyl)-8-methoxy-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl ethyl carbonate (alias: Carbonic acid, 3-(2,5-dimethylphenyl)-8-methoxy-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl ethyl ester, CAS-Reg.-No.: 382608-10-8) and Carbonic acid, cis-3-(2,5-dimethylphenyl)-8-methoxy-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl ethyl ester (CAS-Reg.-No.: 5. 203313-25-1)]

*17. Carboxamide*

(z.B. Flonicamid)

*18. Oktopaminerge Agonisten*

(z.B. Amitraz)

10 19. Inhibitoren der Magnesium-stimulierten ATPase

(z.B. Propargite)

20. Phthalamide

(z.B. N<sup>2</sup>-[1,1-Dimethyl-2-(methylsulfonyl)ethyl]-3-iod-N<sup>1</sup>-[2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluor-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl]-1,2-benzenedicarboxamide (CAS-Reg.-No.: 15. 272451-65-7),

Flubendiamide)

21. Nereistoxin-Analoga

(z.B. Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiosultap-sodium)

22. Biologika, Hormone oder Pheromone

(z.B. Azadirachtin, *Bacillus* spec., *Beauveria* spec., *Codlemone*, *Metarrhizium* spec., *Paecilomyces* 20. spec., *Thuringiensin*, *Verticillium* spec.)

23. Wirkstoffe mit unbekannten oder nicht spezifischen Wirkmechanismen

23.1 Begasungsmittel (z.B. Aluminium phosphide, Methyl bromid, Sulfuryl fluoride)

23.2 Selektive Fraßhemmer (z.B. Cryolite, Flonicamid, Pymetrozine)

23.3 Milbenwachstumsinhibitoren (z.B. Clofentezine, Etoxazole, Hexythiazox)

25. 23.4 Amidoform, Bencllothiaz, Benzoximate, Bifenazate, Bromopropylate, Buprofezin, Chlormethionat, Chlordimeform, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Clothiazoben, Cyclopene, Cyflumetofen,

Dicyclanil, Fenoxacrim, Fentrifanil, Flubenzimine, Flufenerim, Flutenzin, Gossyplure, Hydramethylnone, Japonilure, Metoxadiazone, Petroleum, Piperonyl butoxide, Potassium oleate, Pyrafenone, Pyridalyl, Pyriproxyfen, Sulfluramid, Tetradifon, Tetrasul, Triarathene, Verbutin,

5 ferner die Verbindung 3-Methyl-phenyl-propylcarbamat (Tsumacide Z), die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluorethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3-endo-Isoomere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO 96/37494, WO 98/25923), sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren enthalten.

10 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden, oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren, Safenern bzw. Semiochemicals ist möglich.

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen 15 Candida-Spezies wie *Candida albicans*, *Candida glabrata*) sowie *Epidermophyton floccosum*, *Aspergillus*-Spezies wie *Aspergillus niger* und *Aspergillus fumigatus*, *Trichophyton*-Spezies wie *Trichophyton mentagrophytes*, *Microsporon*-Spezies wie *Microsporon canis* und *audouinii*. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

20 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubermittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren.

25 Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden:

30 Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff „Teile“ bzw. „Teile von Pflanzen“ oder „Pflanzenteile“ wurde oben erläutert.

10 Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften („Traits“), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

15 Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive („synergistische“) Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandsmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

20 Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits“) verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen

bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen").

5 10 15 20 25 30 Als Eigenschaften („Traits“) werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits“) werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits“) verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits“).

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

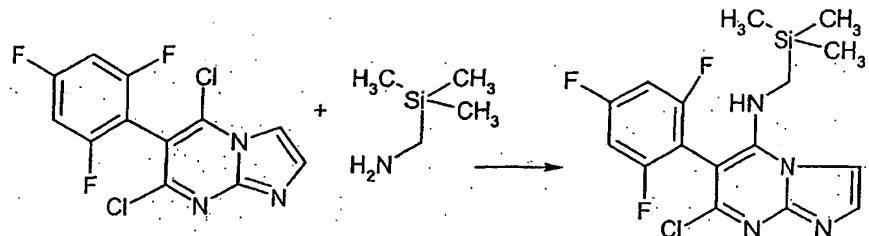
Weiterhin eignen sich die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zur Unterdrückung des Wachstums von Tumorzellen in Menschen und Säugetieren. Dies basiert auf einer Wechselwirkung der erfindungsgemäßen Verbindungen mit Tubulin und Mikrotubuli und durch Förderung der Mikrotubuli-Polymerisation.

- 5 Zu diesem Zweck kann man eine wirksame Menge an einer oder mehreren Verbindungen der Formel (I) oder pharmazeutisch verträglicher Salze davon verabreichen.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

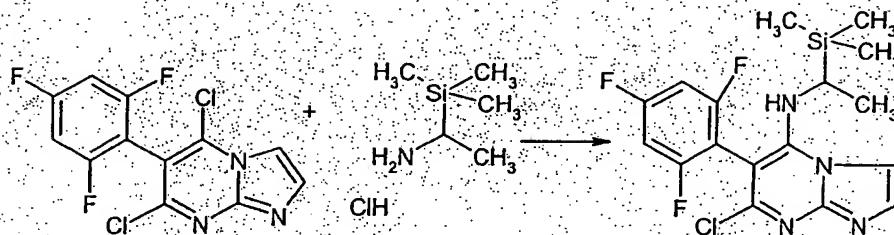
Beispiele

## Beispiel 1



0,5 g (0,002 Mol) 6-(2,4,6-Trifluorophenyl)-5,7-dichlor-imidazo[1,2-a]pyrimidin wurden in 7,8 g  
 5 Acetonitril vorgelegt. Bei Raumtemperatur wurden 0,326 g (0,002 Mol) Kaliumcarbonat und  
 0,162 g (0,002 Mol) Trimethylsilylmethylamin zugegeben und 16 Stunden nachgerührt. Das Reak-  
 tionsgemisch wurde mit Salzsäure sauer gestellt und mit Diethylether extrahiert. Die organische  
 Phase wurde getrocknet und eingeengt. Der Rückstand wurde mit Diethylether verrührt, abgesaugt  
 und getrocknet. Man erhielt 0,2 g 5-Chlor-6-(2,4,6-Trifluorophenyl)-7-trimethylsilylmethylamino-  
 10 imidazo[1,2-a]pyrimidin ( $\log p = 2,09$ ; HPLC-Gehalt 98,6 %)

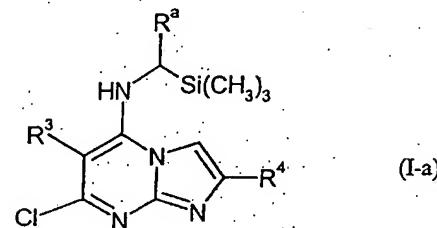
## Beispiel 2.



0,5 g (0,002 Mol) 6-(2,4,6-Trifluorophenyl)-5,7-dichlor-imidazo[1,2-a]pyrimidin wurden in 7,8 g  
 Acetonitril vorgelegt. Bei Raumtemperatur wurden 0,543 g (0,004 Mol) Kaliumcarbonat und  
 15 0,242 g (0,002 Mol) 2-Trimethylsilyl-1-aminoethan zugegeben und 16 Stunden nachgerührt. Das  
 Reaktionsgemisch wurde mit Salzsäure sauer gestellt und mit Diethylether extrahiert. Die orga-  
 nische Phase wurde getrocknet und eingeengt und dann in Cyclohexan : Essigsäureethylester = 1 :  
 1 auf Kieselgel chromatographiert. Man erhielt 0,3 g 5-Chlor-6-(2,4,6-Trifluorophenyl)-7-(1-  
 trimethylsilylethylamino)-imidazo[1,2-a]pyrimidin ( $\log p = 2,18$ ; HPLC-Gehalt 87,4 %)

20 Die Verbindung 6-(2,4,6-Trifluorophenyl)-5,7-dichlor-imidazo[1,2-a]pyrimidin ist bekannt aus  
 WO-A 03/022 850 und aus WO-A 03/089 433.

Analog zu den zuvor angegebenen Methoden werden bzw. wurden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I-a) erhalten.

**Tabelle 1**

Bsp. Nr.	R <sup>a</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	log P	Fp. (°C)
1	H	2,4,6-Trifluorophenyl	H	2,09	
2	CH <sub>3</sub>	2,4,6-Trifluorophenyl	H	2,18	
3	H	2-Cl-4-F-phenyl	H	2,20	
4	CH <sub>3</sub>	2-Cl-4-F-phenyl	H	2,38	
5	H	2-Cl-6-F-Phenyl	H		
6	CH <sub>3</sub>	2-Cl-6-F-Phenyl	H		
7	CH <sub>3</sub>	2-Cl-Phenyl	H		
8	H	3-Cl-5-(CF <sub>3</sub> )-Pyridin-2-yl	H		
9	CH <sub>3</sub>	5-F-Pyrimidin-4-yl	H		
10	CH <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-Pyridin-2-yl	H		
11	CH <sub>3</sub>	2-Cl-6-F-Phenyl	H		
12	H	2-Cl-6-F-Phenyl	H		
13	H	2,5-Difluorophenyl	H		
14	CH <sub>3</sub>	2,5-Difluorophenyl	H		
15	CH <sub>3</sub>	2,5-Difluorophenyl	H		
16	H	2,5-Difluorophenyl	H		
17	CH <sub>3</sub>	2,5-Difluorophenyl	H		
18	H	2,5-Difluorophenyl	H		

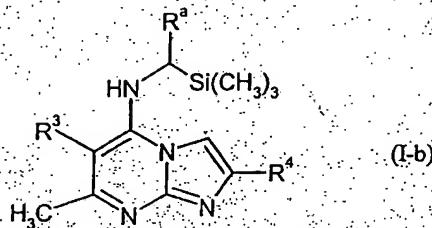
Bsp. Nr.	R <sup>a</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	logP	Fp. (°C)
19	CH <sub>3</sub>	5-F-Pyrimidin-4-yl	H		
20	H	2-Cl-Phenyl	H		
21	CH <sub>3</sub>	2-Cl-Phenyl	H		
22	H	5-F-Pyrimidin-4-yl	H		
23	CH <sub>3</sub>	5-Cl-Pyrimidin-4-yl	H		
24	H	5-Cl-Pyrimidin-4-yl	H		
25	CH <sub>3</sub>	sec-Butyl	H		
26	H	sec-Butyl	H		
27	H	5-F-Pyrimidin-4-yl	H		
28	CH <sub>3</sub>	5-F-Pyrimidin-4-yl	H		
29	H	N(-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
30	CH <sub>3</sub>	N(-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
31	H	N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
32	H	N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
33	H	N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
34	CH <sub>3</sub>	N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
35	H	3,5-Dimethylpyrazol-1-yl	H		
36	CH <sub>3</sub>	3,5-Dimethylpyrazol-1-yl	H		
37	H	N(CH <sub>3</sub> )(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H		
38	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> )(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H		
39	H	3-Thienyl	H		
40	CH <sub>3</sub>	3-Thienyl	H		
41	H	3-F-Phenylthio	H		
42	CH <sub>3</sub>	3-F-Phenylthio	H		
43	H	3-Cl-Phenylthio	H		
44	CH <sub>3</sub>	3-Cl-Phenylthio	H		

Bsp. Nr.	R <sup>a</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	logP	Fp. (°C)
45	H	3-F-Phenyl-CH <sub>2</sub>	H		
46	CH <sub>3</sub>	3-F-Phenyl-CH <sub>2</sub>	H		
47	H	3-Cl-Phenyl-CH <sub>2</sub>	H		
48	CH <sub>3</sub>	3-Cl-Phenyl-CH <sub>2</sub>	H		

Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure).

Analog zu den zuvor angegebenen Methoden werden bzw. würden auch die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der Formel (I-b) erhalten.

Tabelle 2



Bsp. Nr.	R <sup>a</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	logP	Fp. (°C)
1	H	2,4,6-Trifluorophenyl	H		
2	CH <sub>3</sub>	2,4,6-Trifluorophenyl	H		
3	H	2-Cl-4-F-phenyl	H		
4	CH <sub>3</sub>	2-Cl-4-F-phenyl	H		
5	H	2-Cl-6-F-Phenyl	H		
6	CH <sub>3</sub>	2-Cl-6-F-Phenyl	H		
7	CH <sub>3</sub>	2-Cl-Phenyl	H		
8	H	3-Cl-5-(CF <sub>3</sub> )-Pyridin-2-yl	H		
9	CH <sub>3</sub>	5-F-Pyrimidin-4-yl	H		

Bsp. Nr.	R <sup>a</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	logP	Fp. (°C)
10	CH <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-Pyridin-2-yl	H		
11	CH <sub>3</sub>	2-Cl-6-F-Phenyl	H		
12	H	2-Cl-6-F-Phenyl	H		
13	H	2,5-Difluorphenyl	H		
14	CH <sub>3</sub>	2,5-Difluorphenyl	H		
15	CH <sub>3</sub>	2,5-Difluorphenyl	H		
16	H	2,5-Difluorphenyl	H		
17	CH <sub>3</sub>	2,5-Difluorphenyl	H		
18	H	2,5-Difluorphenyl	H		
19	CH <sub>3</sub>	5-F-Pyrimidin-4-yl	H		
20	H	2-Cl-Phenyl	H		
21	CH <sub>3</sub>	2-Cl-Phenyl	H		
22	H	5-F-Pyrimidin-4-yl	H		
23	CH <sub>3</sub>	5-Cl-Pyrimidin-4-yl	H		
24	H	5-Cl-Pyrimidin-4-yl	H		
25	CH <sub>3</sub>	sec-Butyl	H		
26	H	sec-Butyl	H		
27	H	5-F-Pyrimidin-4-yl	H		
28	CH <sub>3</sub>	5-F-Pyrimidin-4-yl	H		
29	H	N(-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
30	CH <sub>3</sub>	N(-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
31	H	N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
32	H	N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
33	H	N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
34	CH <sub>3</sub>	N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
35	H	3,5-Dimethylpyrazol-1-yl	H		

Bsp. Nr.	R <sup>a</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	logP	Fp. (°C)
36	CH <sub>3</sub>	3,5-Dimethylpyrazol-1-yl	H		
37	H	N(CH <sub>3</sub> )(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H		
38	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> )(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H		
39	H	3-Thienyl	H		
40	CH <sub>3</sub>	3-Thienyl	H		
41	H	3-F-Phenylthio	H		
42	CH <sub>3</sub>	3-F-Phenylthio	H		
43	H	3-Cl-Phenylthio	H		
44	CH <sub>3</sub>	3-Cl-Phenylthio	H		
45	H	3-F-Phenyl-CH <sub>2</sub>	H		
46	CH <sub>3</sub>	3-F-Phenyl-CH <sub>2</sub>	H		
47	H	3-Cl-Phenyl-CH <sub>2</sub>	H		
48	CH <sub>3</sub>	3-Cl-Phenyl-CH <sub>2</sub>	H		

Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC  
(Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure).

VerwendungsbeispieleBeispiel AIn vitro-Test zur ED<sub>50</sub>-Bestimmung bei Mikroorganismen

5 In die Kavitäten von Mikrotiterplatten wird eine methanolische Lösung des zu prüfenden Wirkstoffs, versetzt mit dem Emulgator PS16, pipettiert. Nachdem das Lösungsmittel abgedampft ist, werden je Kavität 200 µl Potatoe-Dextrose-Medium hinzugefügt.

Das Medium wurde vorher mit einer geeigneten Konzentration von Sporen bzw. Mycel des zu prüfenden Pilzes versetzt.

10 Die resultierenden Konzentrationen des Wirkstoffs betragen 0,05, 0,5, 5 und 50 ppm. Die resultierende Konzentration des Emulgators beträgt 300 ppm.

Die Platten werden anschließend 3-5 Tage auf einem Schüttler bei einer Temperatur von 200°C inkubiert, bis in der unbehandelten Kontrolle ein ausreichendes Wachstum feststellbar ist.

15 Die Auswertung erfolgt photometrisch bei einer Wellenlänge von 620nm. Aus den Messdaten der verschiedenen Konzentrationen wird die Wirkstoffdosis, die zu einer 50%igen Hemmung des Pilzwachstums gegenüber der unbehandelten Kontrolle führt (ED<sub>50</sub>), berechnet.

Dabei zeigte die Verbindung gemäß Beispiel 2 einen ED<sub>50</sub> Wert von < 1 für *Alternaria mali*, *Botrytis cinerea* und *Ustilago avenae*.

Beispiel B.

## Botrytis - Test (Gurke) / protektiv

Lösungsmittel : 49 Gewichtsteile N,N-Dimethylformamid

Emulgator : 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

5 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Gurkenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. 1 Tag nach der Behandlung werden die

10 Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea* inkuliert und stehen dann 48 h bei 100% rel. Feuchte und 20°C. Anschließend stehen die Pflanzen bei 96% rel. Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 10°C.

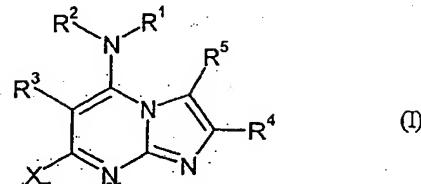
5-6 Tage nach der Inkulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0% ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100% bedeutet, dass kein

15 Befall beobachtet wird.

Die Verbindung gemäß Beispiel 2 zeigte dabei bei einer Aufwandmenge von 750 g/ha einen Wirkungsgrad von > 80%.

Patentansprüche

1. Imidazolopyrimidine der Formel (I),



in welcher

5            R<sup>1</sup>        für H, R<sup>2</sup>, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkinyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht,

10           R<sup>2</sup>        für einen organischen Rest steht, der 3. bis 13 Kohlenstoffatome und ein oder mehrere Siliziumatome enthält, sowie gegebenenfalls 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, und unsubstituiert ist oder substituiert durch 1 bis 4 gleiche oder verschiedene Halogene, oder

15           R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring stehen, der ein oder mehrere Siliziumatome enthält und/oder durch einen oder mehrere Reste R<sup>2</sup> substituiert ist,

20           R<sup>3</sup>        für gegebenenfalls substituiertes Aryl, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkinyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl gegebenenfalls substituiertes Aralkyl, Halogen, oder gegebenenfalls substituierte Aminogruppe, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylthio, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Aryloxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Arylthio, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyoxy, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyloxy, gegebenenfalls substituiertes C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkylthio, gegebenenfalls substituiertes Heterocycl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxy, oder gegebenenfalls substituiertes Heterocycl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkylthio,

25

5                    R<sup>4</sup>            für H, Halogen; gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl steht;

10                R<sup>5</sup>            für H, Halogen, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl steht; und

15                X            für Halogen, Cyano, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht,  
sowie deren Salze.

20                2.            Imidazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in denen

25                R<sup>1</sup>            für H steht, oder

30                R<sup>1</sup>            für einen Rest R<sup>2</sup> steht, oder

35                R<sup>1</sup>            für Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis fünffach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, oder

40                R<sup>1</sup>            für Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, oder

45                R<sup>1</sup>            für Alkinyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, oder

50                R<sup>1</sup>            für Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen und/oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, oder

55                R<sup>1</sup>            für gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl mit 3 bis 8 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroatomen, wie Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel, steht; wobei das Heterocycl einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cyano und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen,

$R^2$  für eine aliphatische, gesättigte oder ungesättigte Gruppe mit 1 bis 13 Kohlenstoffatomen und einem oder mehreren Siliziumatomen steht, die gegebenenfalls 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthält und die unsubstituiert oder durch 1 bis 4 gleiche oder verschiedene Halogenatome substituiert ist, oder

4

10

144

25

30

R<sup>2</sup> für eine aliphatische, gesättigte oder ungesättigte Gruppe mit 1 bis 13 Kohlenstoffatomen und einem oder mehreren Siliziumatomen steht, die gegebenenfalls 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthält und die unsubstituiert oder durch 1 bis 4 gleiche oder verschiedene Halogenatome substituiert ist, oder

$R^1$  und  $R^2$  gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten heterocyclischen Ring mit 3 bis 8 Ringgliedern stehen, der ein oder mehrere Siliziumatome enthält und/oder durch einen oder mehrere Reste  $R^2$  substituiert ist, wobei der Heterocyclus ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglied enthalten kann und wobei der Heterocyclus weiterhin bis zu dreifach substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Fluor- und/oder Chloratomen,

11

25

$R^3$  für  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkinyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl oder Phenyl- $C_1$ - $C_{10}$ -alkyl steht, wobei  $R^3$  unsubstituiert oder teilweise oder vollständig halogeniert ist und/oder gegebenenfalls ein bis drei Reste aus der Gruppe  $R^X$  trägt, oder  $C_1$ - $C_{10}$ -Halogenalkyl, das gegebenenfalls ein bis drei Reste aus der Gruppe  $R^X$  trägt, und  $R^X$  Cyano, Nitro, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Haloalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Haloalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_6$ -alkylamino,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl,  $C_3$ - $C_6$ -Alkinyloxy und gegebenenfalls halogeniertes  $Oxy-C_1-C_4$ -alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -alkenoxy,  $Oxy-C_1-C_4$ -alkenyl- $C_1$ - $C_4$ -alkoxy,  $Oxy-C_1-C_4$ -alkyl- $C_1$ - $C_4$ -alkoxy bedeutet.

R<sup>3</sup> für Phenyl, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch:

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen.

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen:

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen:

5

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 11 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen:

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy carbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoxyiminoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen:

10

## Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen:

in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyyl, 1,4-Butandiyl, Methylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-O-) oder 1,2-Ethylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

15

R<sup>3</sup> für gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl mit 3 bis 8 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, wobei das Heterocycl einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Haloalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Haloalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cyano, Nitro und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen;

oder

25 R<sup>3</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl-amino, Di-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkenylamino, Di-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkinylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-alkinyl-amino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Arylamino, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino oder Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino;

R<sup>4</sup> für H, Halogen, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes Cyclopropyl;

5 R<sup>5</sup> für H, Halogen, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes Cyclopropyl; und

X für H, Fluor, Chlor, Brom oder CN steht.

3. Imidazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2, in denen

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl;

10 R<sup>2</sup> für eine Gruppe Y<sup>2</sup>-Si(O<sub>m</sub>CH<sub>3</sub>)(O<sub>n</sub>CH<sub>3</sub>)(O<sub>p</sub>Y<sup>3</sup>),

wobei m, n und p unabhängig voneinander 0 oder 1;

15 Y<sup>2</sup> eine Bindung oder Alkandiyl, Alkendiyl oder Alkindiyl, die jeweils geradkettig oder verzweigt sind, 1 bis 6, bzw. 2 bis 6 Kohlenstoffatome aufweisen, gegebenenfalls durch ein oder zwei nicht benachbarte Sauerstoffatome unterbrochen und unsubstituiert oder durch ein bis drei gleiche oder verschiedene Halogenatome substituiert sind; und

Y<sup>3</sup> geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit 1 bis 5 bzw. 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, gegebenenfalls durch ein Sauerstoff-Stickstoff- oder Schwefelatom unterbrochen und unsubstituiert oder durch 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Halogenatome substituiert, bedeuten;

20 R<sup>3</sup> für (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, Benzyl oder

25 R<sup>3</sup> für Phenyl, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchloromethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchloromethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethynylxy, Trifluorethynylxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetoxy, Methoxycarbonyl,

Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximino-  
methyl, Methoximinoethyl, Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder  
Cyclohexyl,

für in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, 1,4-Butandiyl, Methylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-O-)  
oder 1,2-Ethylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleich-  
artig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl,  
Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl,  
Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl,

R<sup>3</sup> für Pyridyl, das in 2- oder 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis vierfach, gleichartig  
oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl,  
Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl,  
Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder

R<sup>3</sup> für Pyrimidyl, das in 2- oder 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis dreifach, gleichartig  
oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl,  
Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl,  
Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder

R<sup>3</sup> für Thienyl, das in 2- oder 3-Stellung verknüpft ist und einfach bis dreifach, gleichartig  
oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl,  
Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl,  
Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder

R<sup>3</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylarnino oder Di-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylarnino, oder

R<sup>3</sup> für Thiazolyl, das in 2-, 4- oder 5-Stellung verknüpft ist und einfach bis zweifach, gleich-  
artig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro,  
Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl,  
Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder

R<sup>3</sup> für N-Piperidinyl, N-Tetrazolyl, N-Pyrazolyl, N-Imidazolyl, N-1,2,4-Triazolyl, N-Pyrrolyl,  
oder N-Morpholinyl, die jeweils unsubstituiert oder ein- oder - falls möglich - mehrfach  
gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy,  
Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl  
und/oder Trifluormethyl substituiert sind,

R<sup>4</sup> für H, Cl, F, CH<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder Cyclopropyl,

R<sup>5</sup> für H, Cl, F, CH<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> oder Cyclopropyl, und

X für H, F, Cl, CN, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Fluor- oder Chloratome substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alky

steht.

4. Imidazolopyrimidine der Formel (I) gemäß einem oder mehrere Ansprüche 1 bis 3, in  
5 denen

R<sup>1</sup> für H;

R<sup>2</sup> für SiMe<sub>3</sub>, SiMe<sub>2</sub>Et, SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>,  
SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
10 CHMeSiMe<sub>3</sub>, CHMeSiMe<sub>2</sub>OMe, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Me,  
(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Me, CHMeCH<sub>2</sub>-  
15 SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
CFMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>-  
SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CHMeSiMe<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CHMeSiMe<sub>2</sub>Et, CH<sub>2</sub>CHMeSiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
CHMeCHMeSiMe<sub>3</sub>, CMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>Si-  
20 Me<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>,  
(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et,  
CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, CHMeCH<sub>2</sub>-  
25 CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, CMe=CHSiMe<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, -C≡C-SiMe<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-C≡C-  
SiMe<sub>3</sub> oder -CHMe-C≡C-SiMe<sub>3</sub>,

R<sup>3</sup> für (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-6)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, wobei R<sup>3</sup>  
unsubstituiert oder durch ein oder mehrere Fluor- oder Chloratome substituiert ist,

25 oder

R<sup>3</sup> für 2,4- oder 2,6-disubstituiertes Phenyl, oder für 2-substituiertes Phenyl oder für 2,4,6-  
trisubstituiertes Phenyl;

R<sup>3</sup> für Pyridyl, das in 2- oder 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis vierfach, gleichartig  
oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl,  
30 Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl,  
Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder

$R^3$  für Pyrimidyl, das in 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl;

5  $R^4$  für H, -CH<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, Cl oder Cyclopropyl;

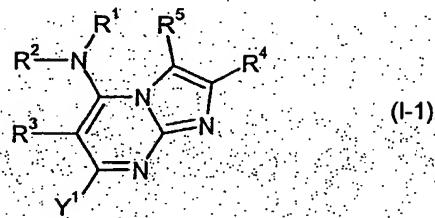
$R^5$  für H, -CH<sub>3</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, Cl oder Cyclopropyl; und

X für Fluor, Chlor, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-Alkyl oder (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-Haloalkyl steht.

5. Verfahren zur Herstellung von Imidazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß einem oder  
10 mehreren der Ansprüche 1 bis 4, wobei

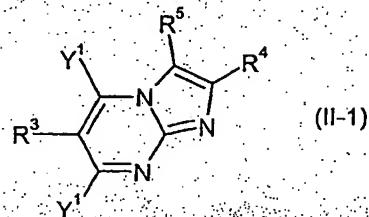
(Verfahren (a))

Imidazolopyrimidine der Formel (I-1), in denen Y<sup>1</sup> für Halogen steht,



15 und die übrigen Symbole die in Formel (I) in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen  
haben,

durch Umsetzung von Halogenimidazolopyrimidinen der Formel (II-1),

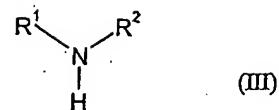


in welcher

$R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y<sup>1</sup> für Halogen steht,

mit Aminen der Formel (III),



in welcher

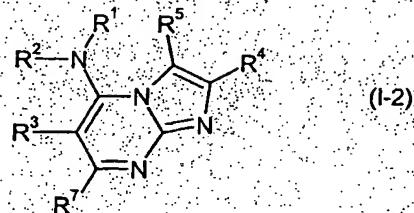
5 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators erhält,

oder

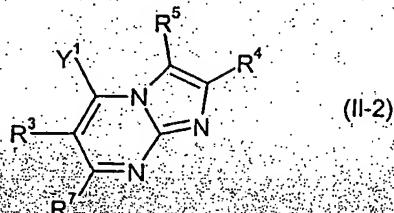
(Verfahren (b))

10 Imidazolopyrimidine der Formel (I-2), in denen R<sup>7</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht,



und die übrigen Symbole die in Formel (I) in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

15 durch Umsetzung von Halogenimidazolopyrimidinen der Formel (II-2),

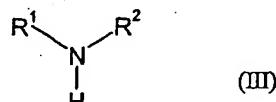


in welcher

$R^3, R^4, R^5$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y<sup>1</sup> für Halogen und R<sup>7</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht,

mit Aminen der Formel (III),



5

in welcher

$R^1$  und  $R^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

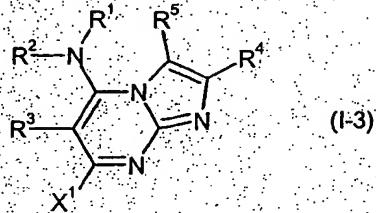
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators erhält,

10

oder

(Verfahren (c))

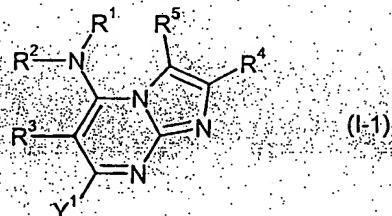
Imidazolopyrimidine der Formel (I-3), in denen X<sup>1</sup> für Cyano oder gegebenenfalls substituiertes Alkoxy steht,



15

und die übrigen Symbole die in Formel (I) in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

aus den oben genannten Imidazolopyrimidine der Formel (I-1),



wobei Y<sup>1</sup> für Halogen steht und die übrigen Symbole die oben angegebenen Bedeutungen haben,

durch Umsetzung mit einer

Verbindung der Formel M-X<sup>1</sup> (IX),

5 in der das Kation M Ammonium, Tetraalkylammonium, ein Alkalimetall oder ein Erdalkalimetall bedeutet, und in der

X<sup>1</sup> Cyano, Alkoxy oder substituiertes Alkoxy bedeutet, erhält.

6. Mittel zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Imidazolopyrimidin der Formel (I) gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

10 7. Mittel gemäß Anspruch 6, dadurch gekennzeichnet, dass es mindestens einen weiteren agrochemischen Wirkstoff enthält.

8. Verwendung von Imidazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

15 9. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Imidazolopyrimidine der Formel (I) gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 auf die unerwünschten Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum aus bringt.

10. 20 Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Imidazolopyrimidine der Formel (I) gemäß einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP2005/001320

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER  
IPC 7 C07D487/04 A01N43/90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
IPC 7 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data, WPI Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, A	EP 1 431 299 A (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) 23 June 2004 (2004-06-23) cited in the application claim 1; table 1	1-10
A	EP 0 122 206 A (RHONE-POULENC AGROCHIMIE) 17 October 1984 (1984-10-17) claim 1	1-10
A	EP 1 334 973 A (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD) 13 August 2003 (2003-08-13) claim 1	1-10

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

## Special categories of cited documents:

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the International filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the International filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the International filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*Z\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the International search

10-June-2005

Date of mailing of the International search report

11/07/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel: (+31-70) 340-2040, Tx: 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Baston, E

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No.

PCT/EP2005/001320

Patent document cited in search report	Publication date		Patent family member(s)	Publication date
EP 1431299	A 23-06-2004	EP	1431299 A1	23-06-2004
		US	2004235865 A1	25-11-2004
		WO	03022850 A1	20-03-2003
		JP	2003155287 A	27-05-2003
EP 0122206	A 17-10-1984	FR	2542742 A1	21-09-1984
		AU	2559584 A	20-09-1984
		BR	8401201 A	23-10-1984
		CS	8401788 A2	13-06-1985
		DD	223906 A5	26-06-1985
		DK	135684 A	17-09-1984
		EP	0122206 A2	17-10-1984
		ES	8500941 A1	01-02-1985
		GR	81819 A1	12-12-1984
		HU	195080 B	28-04-1988
		IL	71210 A	30-10-1987
		JP	59176288 A	05-10-1984
		MA	20061 A1	01-10-1984
		OA	7680 A	23-05-1985
		PL	246665 A1	09-04-1985
		PT	78264 A, B	01-04-1984
		RO	88950 A1	30-04-1986
		TR	21858 A	13-02-1987
		US	4579853 A	01-04-1986
		ZA	8301902 A	31-10-1984
EP 1334973	A 13-08-2003	AU	1522302 A	27-05-2002
		CA	2429067 A1	23-05-2002
		EP	1334973 A1	13-08-2003
		US	2004043998 A1	04-03-2004
		CN	1474818 A	11-02-2004
		WO	0240485 A1	23-05-2002
		JP	2002212076 A	31-07-2002

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP2005/001320A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
IPK 7 C07D487/04 A01N43/90

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
IPK 7 C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data, WPI Data

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENÉ UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P, A	EP 1 431 299 A (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) 23. Juni 2004 (2004-06-23) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1; Tabelle 1	1-10
A	EP 0 122 206 A (RHONE-POULENC AGROCHIMIE) 17. Oktober 1984 (1984-10-17) Anspruch 1	1-10
A	EP 1 334 973 A (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD) 13. August 2003 (2003-08-13) Anspruch 1	1-10

<input type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen:	<input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen: A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem Internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht P* Veröffentlichung, die vor dem Internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist	* T Spätere Veröffentlichung, die nach dem Internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist * X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden * Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist * & Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des Internationalen Recherchenberichts
10. Juni 2005	11/07/2005
Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5018 Patentaan 2. NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter Baston, E

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/001320

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 1431299	A	23-06-2004	EP 1431299 A1 US 2004235865 A1 WO 03022850 A1 JP 2003155287 A	23-06-2004 25-11-2004 20-03-2003 27-05-2003
EP 0122206	A	17-10-1984	FR 2542742 A1 AU 2559584 A BR 8401201 A CS 8401788 A2 DD 223906 A5 DK 135684 A EP 0122206 A2 ES 8500941 A1 GR 81819 A1 HU 195080 B IL 71210 A JP 59176288 A MA 20061 A1 OA 7680 A PL 246665 A1 PT 78264 A ,B RO 88950 A1 TR 21858 A US 4579853 A ZA 8301902 A	21-09-1984 20-09-1984 23-10-1984 13-06-1985 26-06-1985 17-09-1984 17-10-1984 01-02-1985 12-12-1984 28-04-1988 30-10-1987 05-10-1984 01-10-1984 23-05-1985 09-04-1985 01-04-1984 30-04-1986 13-02-1987 01-04-1986 31-10-1984
EP 1334973	A	13-08-2003	AU 1522302 A CA 2429067 A1 EP 1334973 A1 US 2004043998 A1 CN 1474818 A WO 0240485 A1 JP 2002212076 A	27-05-2002 23-05-2002 13-08-2003 04-03-2004 11-02-2004 23-05-2002 31-07-2002

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record.**

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

**BLACK BORDERS**

**IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**

**FADED TEXT OR DRAWING**

**BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**

**SKEWED/SLANTED IMAGES**

**COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**

**GRAY SCALE DOCUMENTS**

**LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**

**REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**

**OTHER:** \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**